

19 BUNDESREPUBLIK  
DEUTSCHLAND



DEUTSCHES  
PATENT- UND  
MARKENAMT

BEST AVAILABLE COPY  
12 Offenlegungsschrift  
10 DE 101 21 162 A 1

Document FP9  
51 Int. Cl. 7: Appl. No. 10/560,437  
C 07 D 487/04  
A 01 N 43/90

DE 101 21 162 A 1

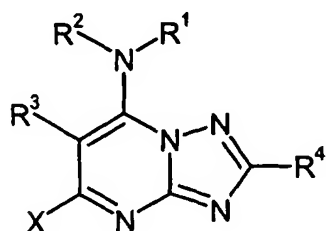
21 Aktenzeichen: 101 21 162.7  
22 Anmeldetag: 30. 4. 2001  
43 Offenlegungstag: 31. 10. 2002

71 Anmelder:  
Bayer AG, 51373 Leverkusen, DE

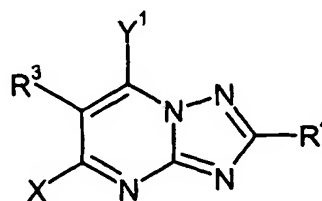
72 Erfinder:  
Gebauer, Olaf, Dr., 51063 Köln, DE; Greul, Jörg  
Nico, Dr., 42799 Leichlingen, DE; Heinemann,  
Ulrich, Dr., 42799 Leichlingen, DE; Elbe,  
Hans-Ludwig, Dr., 42329 Wuppertal, DE; Krüger,  
Bernd-Wieland, Dr., 51467 Bergisch Gladbach, DE;  
Maurer, Fritz, Dr., 40789 Monheim, DE; Dunkel, Ralf,  
Dr., 40789 Monheim, DE; Voerste, Arnd,  
Dipl.-Chem. Dr., 50677 Köln, DE; Ebbert, Ronald,  
Dipl.-Biol. Dr., 51371 Leverkusen, DE;  
Wachendorff-Neumann, Ulrike, Dr., 56566  
Neuwied, DE; Kitagawa, Yoshinori, Dr., Mocha,  
Tochigi, JP; Mauler-Machnik, Astrid, Dipl.-Ing. agr.,  
42799 Leichlingen, DE; Kuck, Karl-Heinz, Dr., 40764  
Langenfeld, DE

Die folgenden Angaben sind den vom Anmelder eingereichten Unterlagen entnommen

- 54 Triazolopyrimidine  
57 Neue Triazolopyrimidine der Formel

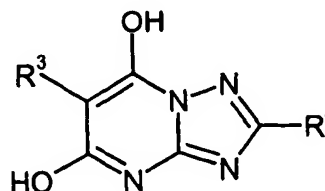


(I),



(II)

in welcher  
R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> und X die in der Beschreibung angegebenen  
Bedeutungen haben,  
mehrere Verfahren zur Herstellung dieser neuen Stoffe  
und deren Verwendung zur Bekämpfung von uner-  
wünschten Mikroorganismen.  
Neue Zwischenprodukte der Formeln



(V)

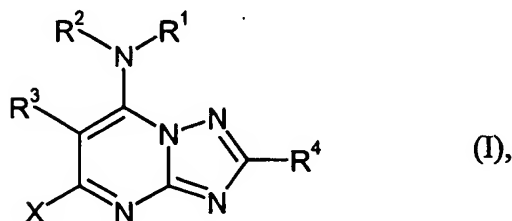
DE 101 21 162 A 1

# Beschreibung

[0001] Die vorliegende Erfindung betrifft neue Triazolopyrimidine, mehrere Verfahren zu deren Herstellung und deren Verwendung zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen. Die Erfindung betrifft außerdem neue Zwischen-

produkte sowie Verfahren zu deren Herstellung.  
[0002] Es ist bereits bekannt geworden, dass bestimmte Triazolopyrimidine fungizide Eigenschaften besitzen (vgl. EP-A 0 550 113, WO 94-20 501, EP-A 0 613 900, US-A 5 612 345, EP-A 0 834 513, WO 98-46 607 und WO 98-46 608). Die Wirksamkeit dieser Stoffe ist gut, lässt aber bei niedrigen Aufwandmengen in manchen Fällen zu wünschen übrig.

[0003] Es wurden nun neue Triazolopyrimidine der Formel



in welcher

R<sup>1</sup> für gegebenenfalls substituiertes Alkyl, gegebenenfalls substituiertes Alkenyl, gegebenenfalls substituiertes Alkynyl, gegebenenfalls substituiertes Cycloalkyl, gegebenenfalls substituiertes Alkoxy, gegebenenfalls substituiertes Alkenyloxy, gegebenenfalls substituiertes Alkinyloxy, gegebenenfalls substituiertes Cycloalkyloxy, gegebenenfalls substituiertes Alkylamino, gegebenenfalls substituiertes Dialkylamino, gegebenenfalls substituiertes Alkenylamino, gegebenenfalls substituiertes Alkynylamino, gegebenenfalls substituiertes Cycloalkylamino, gegebenenfalls substituiertes N-Cycloalkyl-N-alkyl-amino, gegebenenfalls substituiertes Alkylidenamino, gegebenenfalls substituiertes Heterocyclyl oder für einen Rest der Formel -S-R<sup>5</sup> steht, worin

R<sup>5</sup> für gegebenenfalls substituiertes Alkyl, gegebenenfalls substituiertes Alkenyl, gegebenenfalls substituiertes Alkynyl oder gegebenenfalls substituiertes Cycloalkyl steht,

R<sup>2</sup> für Wasserstoff, gegebenenfalls substituiertes Alkyl, gegebenenfalls substituiertes Alkenyl, gegebenenfalls substituiertes Alkynyl oder gegebenenfalls substituiertes Cycloalkyl steht, oder

R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für einen gegebenenfalls substituierten heterocyclischen Ring stehen,

R<sup>3</sup> für gegebenenfalls einfach bis vierfach substituiertes Aryl steht,

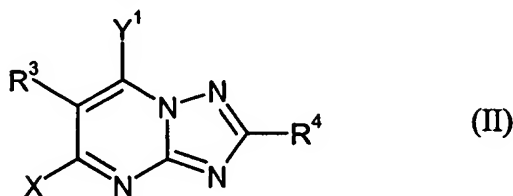
R<sup>4</sup> für gegebenenfalls substituiertes Alkyl steht und

X für Halogen steht,

gefunden.

[0004] Weiterhin wurde gefunden, dass sich Triazolopyrimidine der Formel (I) herstellen lassen, indem man

a) Dihalogen-triazolopyrimidine der Formel

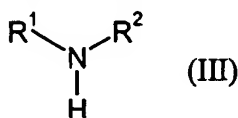


in welcher

R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> und X die oben angegebenen Bedeutungen haben und

Y<sup>1</sup> für Halogen steht,

mit Aminen der Formel



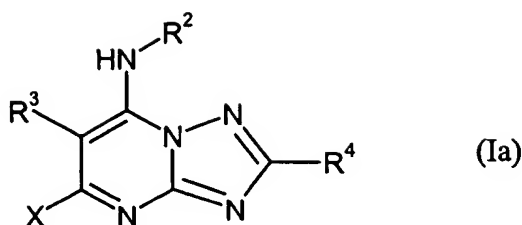
in welcher

R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> die oben angegebenen Bedeutungen haben,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säureakzeptors umgesetzt,

oder

b) Triazolopyrimidine der Formel



in welcher  
 $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$  und X die oben angegebenen Bedeutungen haben,  
 mit Sulfensäurehalogeniden der Formel

$Y^2-S-R^5$  (IV),

in welcher  
 $R^5$  die oben angegebenen Bedeutungen hat und  
 $Y^2$  für Halogen steht,  
 gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säureakzeptors  
 umgesetzt.

[0005] Schließlich wurde gefunden, dass sich die neuen Triazolopyrimidine der Formel (I) sehr gut zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen eignen. Sie zeigen vor allem eine starke fungizide Wirksamkeit und lassen sich sowohl im Pflanzenschutz als auch im Materialschutz verwenden.

[0006] Überraschenderweise besitzen die erfindungsgemäßen Triazolopyrimidine der Formel (I) eine wesentlich bessere mikrobizide Wirksamkeit als die konstitutionell ähnlichsten, vorbekannten Stoffe gleicher Wirkungsrichtung.

[0007] Die erfindungsgemäßen Triazolopyrimidine sind durch die Formel (I) allgemein definiert. Bevorzugt sind diejenigen Stoffe der Formel (I), in denen

$R^1$  für gegebenenfalls durch Halogen, Cyloalkyl, Cyano, Phenyl, Heterocyclyl, Alkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Alkylthio mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Oxo, Hydroxyimino und/oder Alkoximino mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen substituier-  
 tes Alkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen,

für gegebenenfalls durch Halogen, Cyloalkyl, Cyano, Phenyl und/oder Heterocyclyl substituiertes Alkenyl mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen,

für gegebenenfalls durch Halogen, Cyloalkyl, Cyano, Phenyl und/oder Heterocyclyl substituiertes Alkynyl mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen,

für gegebenenfalls durch Halogen, Cyloalkyl, Cyano, Phenyl und/oder Heterocyclyl substituiertes Cycloalkyl mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen,

für gegebenenfalls durch Halogen, Cyloalkyl, Cyano, Phenyl und/oder Heterocyclyl substituiertes Alkoxy mit 1 bis 7 Kohlenstoffatomen,

für gegebenenfalls durch Halogen, Cyloalkyl, Cyano, Phenyl und/oder Heterocyclyl substituiertes Alkenyloxy mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen,

für gegebenenfalls durch Halogen, Cyloalkyl, Cyano, Phenyl und/oder Heterocyclyl substituiertes Alkinyloxy mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen,

für gegebenenfalls durch Halogen, Cyloalkyl, Cyano, Phenyl und/oder Heterocyclyl substituiertes Cycloalkyloxy mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen,

für gegebenenfalls durch Halogen, Cyloalkyl, Cyano, Phenyl und/oder Heterocyclyl substituiertes Alkylamino mit 1 bis 7 Kohlenstoffatomen,

für gegebenenfalls durch Halogen, Cyloalkyl, Cyano, Phenyl und/oder Heterocyclyl substituiertes Dialkylamino mit 1 bis 7 Kohlenstoffatomen in jedem der Alkylreste,

für gegebenenfalls durch Halogen, Cyloalkyl, Cyano, Phenyl und/oder Heterocyclyl substituiertes Alkenylamino mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen,

für gegebenenfalls durch Halogen, Cyloalkyl, Cyano, Phenyl und/oder Heterocyclyl substituiertes Alkynylamino mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen,

für gegebenenfalls durch Halogen, Cyloalkyl, Cyano, Phenyl und/oder Heterocyclyl substituiertes Cycloalkylamino mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen,

für gegebenenfalls durch Halogen, Cyloalkyl, Cyano, Phenyl und/oder Heterocyclyl substituiertes N-Cycloalkyl-N-alkyl-amino mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen im Cycloalkylteil und 1 bis 7 Kohlenstoffatomen in Alkylteil,

für gegebenenfalls durch Halogen, Cyloalkyl, Cyano, Phenyl und/oder Heterocyclyl substituiertes Alkylidenamino mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen,

für gegebenenfalls durch Halogen, Alkyl, Cyloalkyl, Cyano, Phenyl und/oder Heterocyclyl substituiertes Heterocyclyl mit 5 oder 6 Ringgliedern oder

für  $-SR^5$  steht, worin

$R^5$  für gegebenenfalls durch Halogen, Cycloalkyl, Cyano, Phenyl und/oder Heterocyclyl substituiertes Alkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen,

für gegebenenfalls durch Halogen, Cycloalkyl, Cyano, Phenyl und/oder Heterocyclyl substituiertes Alkenyl mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen,

für gegebenenfalls durch Halogen, Cycloalkyl, Cyano, Phenyl und/oder Heterocyclyl substituiertes Alkynyl mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen oder

für gegebenenfalls durch Halogen, Cycloalkyl, Cyano, Phenyl und/oder Heterocyclyl substituiertes Cycloalkyl mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen steht,

wobei die zuvor genannten Heterocyclyl-Reste einfach bis dreifach, gleichartig oder verschieden substituiert sein können durch Halogen, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Halogenalkyl mit 1 oder 2 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen, Alkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Alkylthio mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Halogenalkoxy mit 1 oder 2 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen, Halogenalkylthio mit 1 oder 2 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen und/oder Phenyl, und wobei die zuvor genannten Phenyl-Reste einfach bis dreifach, gleichartig oder verschieden substituiert sein können durch

Halogen, Cyano, Nitro, Amino, Hydroxy, Fonnyl, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl;

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen;

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkenyl oder Alkenyloxy mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen;

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Halogenalkylthio, Halogenalkylsulfinyl oder Halogenalkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 13 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen;

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkenyl oder Halogenalkenyloxy mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 13 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen;

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkylamino, Dialkylamino, Alkylcarbonyl, Alkylcarbonyloxy, Alkoxycarbonyl, Alkylsulfonyloxy, Hydroximinoalkyl oder Alkoximinoalkyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den einzelnen Alkylteilen;

Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen,

oder einfach substituiert sein können durch zweifach in ortho-Stellung verknüpftes Alkylen mit 3 oder 4 Kohlenstoffatomen oder Dioxyalkylen mit 1 oder 2 Kohlenstoffatomen, wobei diese Reste einfach bis vierfach, gleichartig oder verschieden substituiert sein können durch Halogen, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und/oder Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 9 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen,

R<sup>2</sup> für Wasserstoff,

für gegebenenfalls durch Halogen, Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen Alkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Alkylthio mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Oxo, Hydroximino und/oder Alkoximino mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen substituiertes Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen,

für gegebenenfalls durch Halogen und/oder Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen substituiertes Alkenyl mit 2 bis 4 Kohlenstoffatomen,

für gegebenenfalls durch Halogen und/oder Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen substituiertes Alkynyl mit 2 bis 4 Kohlenstoffatomen oder

für gegebenenfalls durch Halogen und/oder Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen substituiertes Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen steht,

oder

R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für einen 3- bis 6-gliedrigen heterocyclischen Ring stehen, der einfach bis dreifach, gleichartig oder verschieden substituiert sein kann durch Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und/oder Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 9 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen,

R<sup>3</sup> für Phenyl steht, das einfach bis vierfach, gleichartig oder verschieden substituiert sein kann durch

Halogen, Cyano, Nitro, Amino, Hydroxy, Fonnyl, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl;

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen;

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkenyl oder Alkenyloxy mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen;

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Halogenalkylthio, Halogenalkylsulfinyl oder Halogenalkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 13 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen;

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkenyl oder Halogenalkenyloxy mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 13 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen;

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkylamino, Dialkylamino, Alkylcarbonyl, Alkylcarbonyloxy, Alkoxycarbonyl, Alkylsulfonyloxy, Hydroximinoalkyl oder Alkoximinoalkyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den einzelnen Alkylteilen;

Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen,

oder einfach substituiert sein kann durch zweifach in ortho-Stellung verknüpftes Alkylen mit 3 oder 4 Kohlenstoffatomen oder Dioxyalkylen mit 1 oder 2 Kohlenstoffatomen, wobei diese Reste einfach bis vierfach, gleichartig oder verschieden substituiert sein können durch Halogen, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und/oder Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 9 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen,

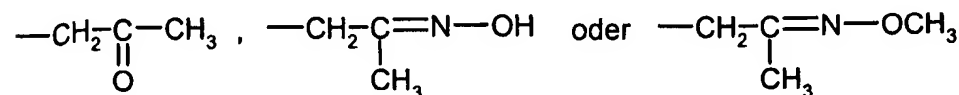
R<sup>4</sup> für gegebenenfalls durch 1 bis 9 Halogenatome substituiertes Alkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen steht

und

X für Fluor, Chlor oder Brom steht.

[0008] Besonders bevorzugt sind Triazolopyrimidine der Formel (I), in denen

R<sup>1</sup> für Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxymethyl, 2-Methoxy-ethyl, Methylthiomethyl, 2-Methylthio-ethyl, Hydroximinomethyl, Methoximinomethyl oder einen Rest der Formel



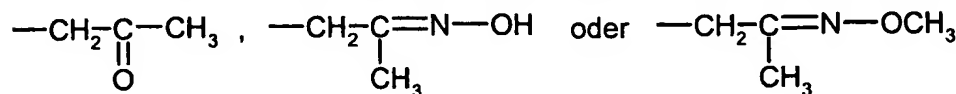
steht,

oder für Allyl, 2-Methyl-prop-2-enyl, Propargyl, 2,2,2-Trifluorethyl, 1-(Trifluormethyl)-ethyl, 3,3,3-Trifluorpropyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cyclopropyloxy, Cyclobutyloxy, Cyclopentyloxy, Cyclohexyloxy, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Difluorchlormethoxy, Trifluorethoxy, Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, n-, i-, s- oder t-Butylamino, Dimethylamino, Diethylamino, Trifluorethylamino, Cyclohexylmethylamino, 2-Cyanethylamino, Allylamino, 1-Cyclopropylethylamino, Cyclopropylamino, Cyclobutylamino, Cyclopentylamino, Cyclohexylamino, 1-Methylethylidenamino, Benzyloxy, Piperidinyl, Morpholinyl, Pyridylmethoxy, Thiazolylmethoxy oder für -S-R<sup>5</sup> steht, worin R<sup>5</sup> für Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Difluormethyl, Difluorchlormethyl, Dichlorfluormethyl oder Trifluormethyl steht, wobei die zuvor genannten Thiazolyl- und Pyridyl-Reste im Falle von Thiazolyl einfach oder zweifach und im Falle von Pyridyl einfach bis dreifach, jeweils gleichartig oder verschieden substituiert sein können durch Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Difluorchlormethoxy, Trifluorethoxy, Difluormethylthio, Difluorchlormethylthio, Dichlorfluormethylthio, Trifluormethylthio und/oder Phenyl, und das zuvor genannte Benzyloxy im Phenylteil einfach bis dreifach, gleichartig oder verschieden substituiert sein kann durch

Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Nitro, Amino, Hydroxy, Formyl, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl, Trifluormethyl, Trifluorethyl, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Difluorchlormethoxy, Trifluorethoxy, Difluormethylthio, Difluorchlormethylthio, Trifluormethylthio, Trifluormethylsulfinyl, Trifluormethylsulfonyl, Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, Dimethylamino, Diethylamino, Acetyl, Propionyl, Acetyloxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Methylsulfonyloxy, Ethylsulfonyloxy, Hydroximinomethyl, Hydroximinomethyl, Methoximinomethyl, Ethoximinomethyl, Methoximinomethyl, Ethoximinomethyl, Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl,

oder einfach substituiert sein kann durch zweifach in ortho-Stellung verknüpftes Propan-1,3-diyl, Methylendioxy oder Ethylendioxy, wobei diese Reste einfach bis vierfach, gleichartig oder verschieden substituiert sein können durch Fluor, Chlor, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl und/oder Trifluormethyl,

R<sup>2</sup> für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxymethyl, 2-Methoxy-ethyl, Methylthiomethyl, 2-Methylthio-ethyl, Hydroximinomethyl, Methoximinomethyl oder einen Rest der Formel



steht,

oder für Allyl, Propargyl, 2,2,2-Trifluorethyl, 1-(1,1,1-Trifluormethyl)ethyl, Cyclopropylmethyl, Cyclobutylmethyl, Cyclopentylmethyl oder Cyclohexylmethyl steht,

oder

R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für gegebenenfalls durch Methyl, Ethyl oder Trifluorethyl substituiertes Pyrrolyl, Piperidinyl, Morpholinyl oder Piperazinyl stehen,

R<sup>3</sup> für Phenyl steht, das einfach bis dreifach, gleichartig oder verschieden substituiert sein kann durch

Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Nitro, Formyl, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Allyl, Propargyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, Allyloxy, Propargyloxy, Trifluormethyl, Trifluorethyl, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Difluorchlormethoxy, Trifluorethoxy, Difluormethylthio, Difluorchlormethylthio, Trifluormethylthio, Trifluormethylsulfinyl, Trifluormethylsulfonyl, Trichlorethinyloxy, Trifluorethinyloxy, Chlorallyloxy, Iodpropargyloxy, Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, Dimethylamino, Diethylamino, Acetyl, Propionyl, Acetyloxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Hydroximinomethyl, Hydroximinomethyl, Methoximinomethyl, Ethoximinomethyl, Methoximinomethyl, Ethoximinomethyl, Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl,

oder einfach substituiert sein kann durch zweifach in ortho-Stellung verknüpftes Propan-1,3-diyl, Methylendioxy oder Ethylendioxy, wobei diese Reste einfach bis vierfach, gleichartig oder verschieden substituiert sein können durch Fluor, Chlor, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl und/oder Trifluormethyl,

R<sup>4</sup> für Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Trifluormethyl oder Trifluorethyl steht

und

X für Fluor oder Chlor steht.

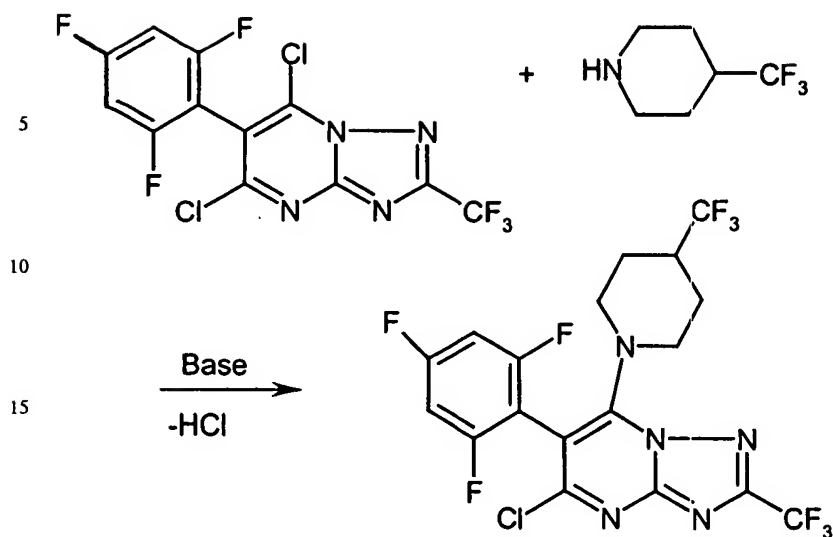
[0009] Ganz besonders bevorzugt sind diejenigen Verbindungen der Formel (I), in denen

R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>4</sup> und X die zuvor genannten bevorzugten Bedeutungen haben und

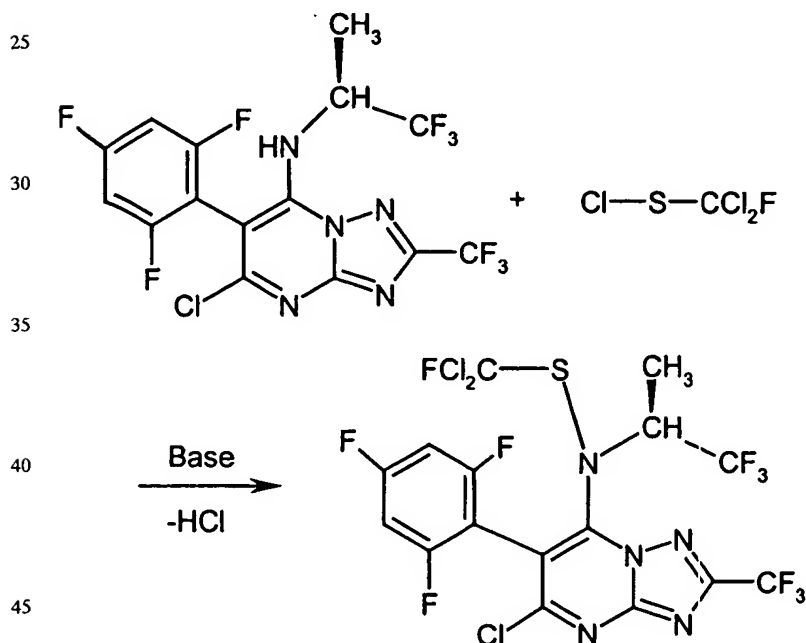
R<sup>3</sup> für 2,4-disubstituiertes, 2,6-disubstituiertes oder 2,4,6-trisubstituiertes Phenyl steht.

[0010] Die zuvor genannten Reste-Definitionen können untereinander in beliebiger Weise kombiniert werden. Außerdem können auch einzelne Bedeutungen entfallen.

[0011] Verwendet man 5,7-Dichlor-2-(trifluormethyl)-6-(2,4,6-trifluorphenyl)-[1,2,4]-triazolo[1,5-a]-pyrimidin und 4-Trifluormethylpiperidin als Ausgangsstoffe, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden.



[0012] Verwendet man 5-Chlor-2-(trifluormethyl)-N-[(1S)-2,2,2-trifluor-1-methyl-ethyl]-6-(2,4,6-trifluorphenyl)-[1,2,4]-triazolo-[1,5-a]pyrimidin-7-amin und Dichlorfluormethan-sulfenylchlorid als Ausgangsstoffe, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden.

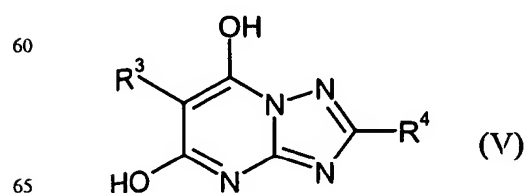


[0013] Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) als Ausgangsstoffe benötigten Dihalogen-triazolo-pyrimidine sind durch die Formel (II) allgemein definiert. In dieser Formel haben  $R^3$ ,  $R^4$  und X vorzugsweise diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt genannt wurden.  $Y^1$  steht vorzugsweise für Fluor, Chlor oder Brom, besonders bevorzugt für Fluor oder Chlor.

[0014] Die Dihalogen-triazolopyrimidine der Formel (II) sind neu. Auch diese Stoffe eignen sich zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen.

[0015] Die Dihalogen-triazolopyrimidine lassen sich herstellen, indem man

c) Dihydroxy-triazolo-pyrimidine der Formel



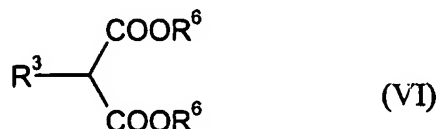
in welcher  
 $R^3$  und  $R^4$  die oben angegebenen Bedeutungen haben,

mit Halogenierungsmitteln, gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt.

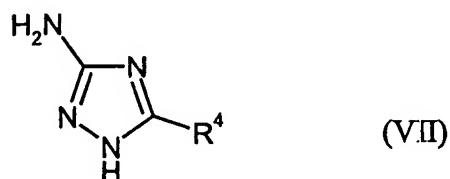
[0016] Die bei der Durchführung des Verfahrens (c) als Ausgangsstoffe benötigten Dihydroxy-triazolopyrimidine sind durch die Formel (V) allgemein definiert. In dieser Formel haben  $R^3$  und  $R^4$  vorzugsweise diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt genannt wurden.

[0017] Auch die Dihydroxy-triazolopyrimidine der Formel (V) sind bisher noch nicht bekannt. Sie lassen sich herstellen, indem man

d) Arylmalonester der Formel



in welcher  $R^3$  die oben angegebenen Bedeutungen hat und  $R^6$  für Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen steht, mit Aminotriazolen der Formel



in welcher  $R^4$  die oben angegebenen Bedeutungen hat, gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels umgesetzt.

[0018] Die bei der Durchführung des Verfahrens (d) als Ausgangsstoffe benötigten Arylmalonester sind durch die Formel (VI) allgemein definiert. In dieser Formel hat  $R^3$  vorzugsweise diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diesen Rest als bevorzugt genannt wurden.  $R^6$  steht vorzugsweise für Methyl oder Ethyl.

[0019] Die Arylmalonester der Formel (VI) sind bekannt oder lassen sich nach bekannten Methoden herstellen (vgl. US-A 6 156 925).

[0020] Die bei der Durchführung des Verfahrens (d) weiterhin als Ausgangsstoffe benötigten Aminotriazole sind durch die Formel (VII) allgemein definiert. In dieser Formel hat  $R^4$  vorzugsweise diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diesen Rest als bevorzugt genannt wurden.

[0021] Die Aminotriazole der Formel (VII) sind bekannt oder können nach bekannten Methoden hergestellt werden (vergl. J. Org. Chem. (1974), 39(11), Khim. Geterotsikl. Soedin. (1989), (2), 278 oder Zh. Obshch. Khim. (1969), 39(11)).

[0022] Als Verdünnungsmittel kommen bei der Durchführung des Verfahrens (d) alle für derartige Umsetzungen üblichen, inerten organischen Solventien in Frage. Vorzugsweise verwendbar sind Alkohole, wie Methanol, Ethanol, n-Propanol, i-Propanol, n-Butanol und tert.-Butanol.

[0023] Als Säurebindemittel kommen bei der Durchführung des Verfahrens (d) alle für derartige Umsetzungen üblichen anorganischen und organischen Basen in Betracht. Vorzugsweise verwendbar sind tertiäre Amine, wie Tributylamin oder Pyridin. Im Überschuss eingesetztes Amin kann auch als Verdünnungsmittel fungieren.

[0024] Die Temperaturen können bei der Durchführung des Verfahrens (d) in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen 20°C und 200°C, vorzugsweise zwischen 50°C und 180°C.

[0025] Bei der Durchführung des Verfahrens (d) arbeitet man im allgemeinen unter Atmosphärendruck. Es ist allerdings auch möglich, unter erhöhtem oder vermindertem Druck zu arbeiten.

[0026] Bei der Durchführung des Verfahrens (d) setzt man Arylmalonester der Formel (VI) und Aminotriazol der Formel (VII) im allgemeinen in äquivalenten Mengen um. Es ist aber auch möglich, die eine oder andere Komponente in einem Überschuss zu verwenden. Die Aufarbeitung erfolgt nach üblichen Methoden.

[0027] Als Halogenierungsmittel kommen bei der Durchführung des Verfahrens (c) alle für den Ersatz von Hydroxygruppen durch Halogen üblichen Komponenten in Betracht. Vorzugsweise verwendbar sind Phosphortrichlorid, Phosphortribromid, Phosphorpentachlorid, Phosphoroxychlorid, Thionylchlorid, Thionylbromid oder deren Gemische. Die entsprechenden Fluor-Verbindungen der Formel (II) lassen sich aus den Chlor- oder Brom-Verbindungen durch Umsetzung mit Kaliumfluorid herstellen.

[0028] Als Verdünnungsmittel kommen bei der Durchführung des Verfahrens (c) alle für derartige Halogenierungen üblichen Solventien in Frage. Vorzugsweise verwendbar sind halogenierte aliphatische oder aromatische Kohlenwasserstoffe, wie Chlorbenzol. Als Verdünnungsmittel kann aber auch das Halogenierungsmittel selbst, z. B. Phosphoroxychlorid oder ein Gemisch von Halogenierungsmitteln fungieren.

[0029] Die Temperaturen können auch bei der Durchführung des Verfahrens (c) in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen 0°C und 150°C, vorzugsweise zwischen 10°C und 120°C.

[0030] Bei der Durchführung des Verfahrens (c) arbeitet man im allgemeinen unter Atmosphärendruck. Es ist aber auch möglich, unter erhöhtem Druck zu arbeiten.

[0031] Bei der Durchführung des Verfahrens (d) setzt man Dihydroxy-triazolpyrimidin der Formel (V) im allgemeinen mit einem Überschuss an Halogenierungsmittel um. Die Aufarbeitung erfolgt nach üblichen Methoden.

[0032] Die weiterhin zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) als Ausgangsstoffe benötigten Amine sind durch die Formel (III) allgemein definiert. In dieser Formel haben R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> vorzugsweise diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) für R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> als bevorzugt angegeben wurden.

[0033] Die Amine der Formel (III) sind bekannt oder lassen sich nach bekannten Methoden herstellen.

[0034] Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) als Ausgangsstoffe benötigten Triazolopyrimidine sind durch die Formel (Ia) allgemein definiert. In dieser Formel haben R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> und X vorzugsweise diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt genannt wurden.

[0035] Bei den Triazolopyrimidinen der Formel (Ia) handelt es sich um erfindungsgemäße Stoffe. Sie lassen sich nach dem erfindungsgemäßen Verfahren (a) herstellen.

[0036] Die weiterhin zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) als Ausgangsstoffe benötigten Sulfensäurehalogenide sind durch die Formel (IV) allgemein definiert. In dieser Formel hat R<sup>5</sup> vorzugsweise diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) für diesen Rest als bevorzugt genannt wurden.

[0037] Y<sup>2</sup> steht vorzugsweise für Fluor, Chlor oder Brom, besonders bevorzugt für Chlor.

[0038] Die Sulfensäurehalogenide der Formel (IV) sind bekannt oder lassen sich nach bekannten Methoden herstellen.

[0039] Als Verdünnungsmittel kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) alle üblichen, inerten organischen Solventien in Betracht. Vorzugsweise verwendbar sind aliphatische, alicyclische oder aromatische Kohlenwasserstoffe, wie Petrolether, Hexan, Heptan, Cyclohexan, Methylcyclohexan, Benzol, Toluol, Xylol oder Decalin; halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Dichlormethan, Chloroform, Tetrachlormethan, Dichlorethan oder Trichlorethan; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Methyl-t-butylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2-Dimethoxyethan oder 1,2-Diethoxyethan; Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid oder N-Methylpyrrolidon; Ester wie Essigsäuremethylester oder Essigsäureethylester; Sulfoxide, wie Dimethylsulfoxid; Sulfone, wie Sulfolan.

[0040] Als Säureakzeptoren kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) alle für derartige Umsetzungen üblichen Säurebindemittel in Frage. Vorzugsweise verwendbar sind tertiäre Amine, wie Trimethylamin, Triethylamin, Tributylamin, N,N-Dimethylanilin, N,N-Dimethyl-benzylamin, Pyridin, N-Methylpiperidin, N-Methylmorpholin, N,N-Dimethylaminopyridin, Diazabicyclooctan (DABCO), Diazabicyclononen (DBN) oder Diazabicycloundecen (DBU).

[0041] Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen 0°C und 150°C, vorzugsweise bei Temperaturen zwischen 0°C und 80°C.

[0042] Sowohl bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) als auch des Verfahrens (b) arbeitet man im allgemeinen unter Atmosphärendruck. Es ist aber auch möglich, unter erhöhtem oder vermindertem Druck, im allgemeinen zwischen 0,1 und 10 bar, zu arbeiten.

[0043] Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) setzt man auf 1 mol an Dihalogen-triazolopyrimidin der Formel (II) im allgemeinen 0,5 bis 10 mol, vorzugsweise 0,8 bis 2 mol an Amin der Formel (III) ein. Die Aufarbeitung erfolgt nach üblichen Methoden.

[0044] Als Verdünnungsmittel kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) alle üblichen, inerten organischen Solventien in Betracht. Vorzugsweise verwendbar sind Ether, wie Diethylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2-Dimethoxyethan, 1,2-Diethoxyethan oder Anisol; Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid oder N-Methylpyrrolidon; Sulfone, wie Sulfolan.

[0045] Als Säureakzeptoren kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) alle für derartige Umsetzungen üblichen anorganischen und organischen Basen in Frage. Vorzugsweise verwendbar sind Erdalkalimetall- oder Alkalimetallhydride, -hydroxide, -amide, -alkoholate, -acetate, -carbonate oder -hydrogencarbonate, wie beispielsweise Natriumhydrid, Natriumamid, Natrium-methylat, Natriumethylat, Kalium-tert.-butylat, Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid, Natriumacetat, Kaliumacetat, Calciumacetat, Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat, Kaliumhydrogencarbonat und Natriumhydrogencarbonat, und außerdem Ammonium-Verbindungen, wie Ammoniumhydroxid, Ammoniumacetat und Ammoniumcarbonat.

[0046] Auch bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) können die Reaktionstemperaturen innerhalb eines größeren Bereiches variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen -40°C und +120°C, vorzugsweise zwischen -20°C und +50°C.

[0047] Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) setzt man auf 1 mol an Triazolopyrimidin der Formel (Ia) im allgemeinen 1 bis 15 mol, vorzugsweise 1 bis 8 mol an Sulfensäurehalogenid der Formel (IV) ein. Die Aufarbeitung erfolgt nach üblichen Methoden.

[0048] Die erfindungsgemäßen Stoffe weisen eine starke mikrobizide Wirkung auf und können zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen, wie Fungi und Bakterien, im Pflanzenschutz und im Materialschutz eingesetzt werden.

[0049] Fungizide lassen sich Pflanzenschutz zur Bekämpfung von Plasmodiophoromycetes, Oomycetes, Chytridiomycetes, Zygomycetes, Ascomycetes, Basidiomycetes und Deuteromycetes einsetzen.



- [0050] Bakterizide lassen sich im Pflanzenschutz zur Bekämpfung von Pseudomonadaceae, Rhizobiaceae, Enterobacteriaceae, Corynebacteriaceae und Streptomycetaceae einsetzen.
- [0051] Beispielhaft aber nicht begrenzend seien einige Erreger von pilzlichen und bakteriellen Erkrankungen, die unter die oben aufgezählten Oberbegriffe fallen, genannt:
- Xanthomonas-Arten, wie beispielsweise *Xanthomonas campestris* pv. *oryzae*; 5
- Pseudomonas-Arten, wie beispielsweise *Pseudomonas syringae* pv. *lachrymans*;
- Erwinia-Arten, wie beispielsweise *Erwinia amylovora*;
- Pythium-Arten, wie beispielsweise *Pythium ultimum*;
- Phytophthora-Arten, wie beispielsweise *Phytophthora infestans*;
- Pseudoperonospora-Arten, wie beispielsweise *Pseudoperonospora humuli* oder *Pseudoperonospora cubensis*; 10
- Plasmopara-Arten, wie beispielsweise *Plasmopara viticola*;
- Bremia-Arten, wie beispielsweise *Bremia lactucae*;
- Peronospora-Arten, wie beispielsweise *Peronospora pisi* oder *P. brassicae*;
- Erysiphe-Arten, wie beispielsweise *Erysiphe graminis*;
- Sphaerotheca-Arten, wie beispielsweise *Sphaerotheca fuliginea*; 15
- Podosphaera-Arten, wie beispielsweise *Podosphaera leucotricha*;
- Venturia-Arten, wie beispielsweise *Venturia inaequalis*;
- Pyrenophora-Arten, wie beispielsweise *Pyrenophora teres* oder *P. graminea* (Konidienform: *Drechslera*, Syn: *Helminthosporium*);
- Cochliobolus-Arten, wie beispielsweise *Cochliobolus sativus* (Konidienform: *Drechslera*, Syn: *Helminthosporium*); 20
- Uromyces-Arten, wie beispielsweise *Uromyces appendiculatus*;
- Puccinia-Arten, wie beispielsweise *Puccinia recondita*;
- Sclerotinia-Arten, wie beispielsweise *Sclerotinia sclerotiorum*;
- Tilletia-Arten, wie beispielsweise *Tilletia caries*;
- Ustilago-Arten, wie beispielsweise *Ustilago nuda* oder *Ustilago avenae*; 25
- Pellicularia-Arten, wie beispielsweise *Pellicularia sasakii*;
- Pyricularia-Arten, wie beispielsweise *Pyricularia oryzae*;
- Fusarium-Arten, wie beispielsweise *Fusarium culmorum*;
- Botrytis-Arten, wie beispielsweise *Botrytis cinerea*;
- Septoria-Arten, wie beispielsweise *Septoria nodorum*; 30
- Leptosphaeria-Arten, wie beispielsweise *Leptosphaeria nodorum*;
- Cercospora-Arten, wie beispielsweise *Cercospora canescens*;
- Alternaria-Arten, wie beispielsweise *Alternaria brassicae*;
- Pseudocercospora-Arten, wie beispielsweise *Pseudocercospora herpotrichoides*.
- [0052] Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe weisen auch eine sehr gute stärkende Wirkung in Pflanzen auf. Sie eignen sich daher zur Mobilisierung pflanzeigener Abwehrkräfte gegen Befall durch unerwünschte Mikroorganismen. 35
- [0053] Unter pflanzenstärkenden (resistenzinduzierenden) Stoffen sind im vorliegenden Zusammenhang solche Substanzen zu verstehen, die in der Lage sind, das Abwehrsystem von Pflanzen so zu stimulieren, dass die behandelten Pflanzen bei nachfolgender Inokulation mit unerwünschten Mikroorganismen weitgehende Resistenz gegen diese Mikroorganismen entfalten. 40
- [0054] Unter unerwünschten Mikroorganismen sind im vorliegenden Fall phytopathogene Pilze, Bakterien und Viren zu verstehen. Die erfindungsgemäßen Stoffe können also eingesetzt werden, um Pflanzen innerhalb eines gewissen Zeitraumes nach der Behandlung gegen den Befall durch die genannten Schaderreger zu schützen. Der Zeitraum, innerhalb dessen Schutz herbeigeführt wird, erstreckt sich im allgemeinen von 1 bis 10 Tage, vorzugsweise 1 bis 7 Tage nach der Behandlung der Pflanzen mit den Wirkstoffen. 45
- [0055] Die gute Pflanzenverträglichkeit der Wirkstoffe in den zur Bekämpfung von Pflanzenkrankheiten notwendigen Konzentrationen erlaubt eine Behandlung von oberirdischen Pflanzenteilen, von Pflanz- und Saatgut, und des Bodens.
- [0056] Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe eignen sich auch zur Steigerung des Ernteertrages. Sie sind außerdem mindertoxisch und weisen eine gute Pflanzenverträglichkeit auf.
- [0057] Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können in bestimmten Konzentrationen und Aufwandmengen auch als Herbizide, zur Beeinflussung des Pflanzenwachstums, sowie zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen verwendet werden. Sie lassen sich auch als Zwischen- und Vorprodukte für die Synthese weiterer Wirkstoffe einsetzen. 50
- [0058] Mit den erfindungsgemäßen Wirkstoffen können Pflanzen und Pflanzenteile behandelt werden. Unter Pflanzen werden hierbei alle Pflanzen und Pflanzenpopulationen verstanden, wie erwünschte und unerwünschte Wildpflanzen oder Kulturpflanzen (einschließlich natürlich vorkommender Kulturpflanzen). Kulturpflanzen können Pflanzen sein, die durch konventionelle Züchtungs- und Optimierungsmethoden oder durch biotechnologische und gentechnologische Methoden oder Kombinationen dieser Methoden erhalten werden können, einschließlich der transgenen Pflanzen und einschließlich der durch Sortenschutzrechte schützbaaren oder nicht schützbaaren Pflanzensorten. Unter Pflanzenteilen sollen alle oberirdischen und unterirdischen Teile und Organe der Pflanzen, wie Spross, Blatt, Blüte und Wurzel verstanden werden, wobei beispielhaft Blätter, Nadeln, Stengel, Stämme, Blüten, Fruchtkörper, Früchte und Samen sowie Wurzeln, Knollen und Rhizome aufgeführt werden. Zu den Pflanzenteilen gehört auch Erntegut sowie vegetatives und generatives Vermehrungsmaterial, beispielsweise Stecklinge, Knollen, Rhizome, Ableger und Samen. 55
- [0059] Die Behandlung der Pflanzen und Pflanzenteile mit den erfindungsgemäßen Wirkstoffen erfolgt direkt oder durch Einwirkung auf deren Umgebung, Lebensraum oder Lagerraum nach den üblichen Behandlungsmethoden, z. B. durch Tauchen, Sprühen, Verdampfen, Vernebeln, Streuen, Aufstreichen und bei Vermehrungsmaterial, insbesondere bei Samen, weiterhin durch ein- oder mehrschichtiges Umhüllen. 60
- [0060] Im Materialschutz lassen sich die erfindungsgemäßen Stoffe zum Schutz von technischen Materialien gegen Befall und Zerstörung durch unerwünschte Mikroorganismen einsetzen. 65

[0061] Unter technischen Materialien sind im vorliegenden Zusammenhang nichtlebende Materialien zu verstehen, die für die Verwendung in der Technik zubereitet worden sind. Beispielsweise können technische Materialien, die durch erfindungsgemäße Wirkstoffe vor mikrobieller Veränderung oder Zerstörung geschützt werden sollen, Klebstoffe, Leime, Papier und Karton, Textilien, Leder, Holz, Anstrichmittel und Kunststoffartikel, Kühlschmierstoffe und andere Materialien sein, die von Mikroorganismen befallen oder zersetzt werden können. Im Rahmen der zu schützenden Materialien seien auch Teile von Produktionsanlagen, beispielsweise Kühlwasserkreisläufe, genannt, die durch Vermehrung von Mikroorganismen beeinträchtigt werden können. Im Rahmen der vorliegenden Erfindung seien als technische Materialien vorzugsweise Klebstoffe, Leime, Papiere und Kartone, Leder, Holz, Anstrichmittel, Kühlschmiermittel und Wärmeübertragungsflüssigkeiten genannt, besonders bevorzugt Holz.

[0062] Als Mikroorganismen, die einen Abbau oder eine Veränderung der technischen Materialien bewirken können, seien beispielsweise Bakterien, Pilze, Hefen, Algen und Schleimorganismen genannt. Vorzugsweise wirken die erfindungsgemäßen Wirkstoffe gegen Pilze, insbesondere Schimmelpilze, holzverfärbende und holzzerstörende Pilze (Basidiomyceten) sowie gegen Schleimorganismen und Algen.

[0063] Es seien beispielsweise Mikroorganismen der folgenden Gattungen genannt:

Alternaria, wie *Alternaria tenuis*,  
Aspergillus, wie *Aspergillus niger*,  
Chaetomium, wie *Chaetomium globosum*,  
Coniophora, wie *Coniophora puetana*,  
Lentinus, wie *Lentinus tigrinus*,  
Penicillium, wie *Penicillium glaucum*,  
Polyporus, wie *Polyporus versicolor*,  
Aureobasidium, wie *Aureobasidium pullulans*,  
Sclerophoma, wie *Sclerophoma pityophila*,  
Trichoderma, wie *Trichoderma viride*,  
Escherichia, wie *Escherichia coli*,  
Pseudomonas, wie *Pseudomonas aeruginosa*,  
Staphylococcus, wie *Staphylococcus aureus*.

[0064] Die Wirkstoffe können in Abhängigkeit von ihren jeweiligen physikalischen und/oder chemischen Eigenschaften in die üblichen Formulierungen überführt werden, wie Lösungen, Emulsionen, Suspensionen, Pulver, Schäume, Pasten, Granulate, Aerosole, Feinstverkapselungen in polymeren Stoffen und in Hüllmassen für Saatgut, sowie ULV-Kalt- und Warmnebel-Formulierungen.

[0065] Diese Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z. B. durch Vermischen der Wirkstoffe mit Streckmitteln, also flüssigen Lösungsmitteln, unter Druck stehenden verflüssigten Gasen und/oder festen Trägerstoffen, gegebenenfalls unter Verwendung von oberflächenaktiven Mitteln, also Emulgiermitteln und/oder Dispergiermitteln und/oder schaum erzeugenden Mitteln. Im Falle der Benutzung von Wasser als Streckmittel können z. B. auch organische Lösungsmittel als Hilfslösungsmittel verwendet werden. Als flüssige Lösungsmittel kommen im wesentlichen in Frage: Aromaten, wie Xylol, Toluol oder Alkyl-naphthaline, chlorierte Aromaten oder chlorierte aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Chlorbenzole, Chlorethylene oder Methylenchlorid, aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Cyclohexan oder Paraffine, z. B. Erdölfractionen, Alkohole, wie Butanol oder Glycol sowie deren Ether und Ester, Ketone, wie Aceton, Methylethylketon, Methylisobutylketon oder Cyclohexanon, stark polare Lösungsmittel, wie Dimethylformamid und Dimethylsulfoxid, sowie Wasser. Mit verflüssigten gasförmigen Streckmitteln oder Trägerstoffen sind solche Flüssigkeiten gemeint, welche bei normaler Temperatur und unter Normaldruck gasförmig sind, z. B. Aerosol-Treibgase, wie Halogenkohlenwasserstoffe sowie Butan, Propan, Stickstoff und Kohlendioxid. Als feste Trägerstoffe kommen in Frage: z. B. natürliche Gesteinsmehle, wie Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide, Quarz, Attapulgit, Montmorillonit oder Diatomeenerde und synthetische Gesteinsmehle, wie hochdisperse Kieselsäure, Aluminiumoxid und Silikate. Als feste Trägerstoffe für Granulate kommen in Frage: z. B. gebrochene und fraktionierte natürliche Gesteine wie Calcit, Marmor, Bims, Sepiolith, Dolomit sowie synthetische Granulate aus anorganischen und organischen Mehlen sowie Granulate aus organischem Material wie Sägemehl, Kokosnussschalen, Maiskolben und Tabakstengel. Als Emulgier und/oder schaum erzeugende Mittel kommen in Frage: z. B. nichtionogene und anionische Emulgatoren, wie Polyoxyethylen-Fettsäureester, Polyoxyethylen-Fettalkoholether, z. B. Alkylaryl-polyglycolether, Alkylsulfonate, Alkylsulfate, Arylsulfonate sowie Eiweißhydrolysate. Als Dispergiermittel kommen in Frage: z. B. Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.

[0066] Es können in den Formulierungen Haftmittel wie Carboxymethylcellulose, natürliche und synthetische pulverige, körnige oder latexförmige Polymere verwendet werden, wie Gummiarabicum, Polyvinylalkohol, Polyvinylacetat, sowie natürliche Phospholipide, wie Cephaline und Lecithine, und synthetische Phospholipide. Weitere Additive können mineralische und vegetabile Öle sein.

[0067] Es können Farbstoffe wie anorganische Pigmente, z. B. Eisenoxid, Titanoxid, Ferrocyanblau und organische Farbstoffe, wie Alizarin-, Azo- und Metallphthalocyaninfarbstoffe und Spurennährstoffe, wie Salze von Eisen, Mangan, Bor, Kupfer, Kobalt, Molybdän und Zink verwendet werden.

[0068] Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,1 und 95 Gewichtsprozent Wirkstoff, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90%.

[0069] Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können als solche oder in ihren Formulierungen auch in Mischung mit bekannten Fungiziden, Bakteriziden, Akariziden, Nematiziden oder Insektiziden verwendet werden, um so z. B. das Wirkungsspektrum zu verbreitern oder Resistenzentwicklungen vorzubeugen. In vielen Fällen erhält man dabei synergistische Effekte, d. h. die Wirksamkeit der Mischung ist größer als die Wirksamkeit der Einzelkomponenten.

[0070] Als Mischpartner kommen zum Beispiel folgende Verbindungen in Frage:

## Fungizide

Aldimorph, Ampropylfos, Ampropylfos-Kalium, Andoprim, Anilazin, Azaconazol, Azoxystrobin, Benalaxyl, Benodanil, Benomyl, Benzamacril, Benzamacryl-isobutyl, Bialaphos, Binapacryl, Biphenyl, Bitertanol, Blasticidin-S, Bromuconazol, Bupirimat, Buthiobat,	5
Calciumpolysulfid, Capsimycin, Captafol, Captan, Carbendazim, Carboxin, Carvon, Chinomethionat (Quinomethionat), Chlobenthiazon, Chlorfenazol, Chloroneb, Chloropicrin, Chlorothalonil, Chlozolinat, Clozylacon, Cufraneb, Cymoxanil, Cyproconazol, Cyprodinil, Cyprofuram, Carpropamid,	
Debacarb, Dichlorophen, Diclobutrazol, Diclofluanid, Diclomezin, Dicloran, Diethofencarb, Difenconazol, Dimethirimol, Dimethomorph, Diniconazol, Diniconazol-M, Dinocap, Diphenylamin, Dipyrithione, Ditalimfos, Dithianon, Dode-	10
morph, Dodine, Drazoxolon, Ediphenphos, Epoxiconazol, Etaconazol, Ethirimol, Etridiazol, Famoxadon, Fenapanil, Fenarimol, Fenbuconazol, Fenfuram, Fenitropan, Fenpiclonil, Fenpropidin, Fenpropimorph, Fentinacetat, Fentinhydroxyd, Ferbam, Ferimzon, Fluazinam, Flumetover, Fluoromid, Fluquinconazol, Flurprimidol, Flusilazol, Flusulfamid, Flutolanil, Flutriafol, Folpet, Fosetyl-Aluminium, Fosetyl-Natrium, Fthalid, Fuberidazol, Fura-	15
laxyl, Furametypr, Furcarbonil, Furconazol, Furconazol-cis, Fumecyclo, Fenhexamid, Guazatin, Hexachlorobenzol, Hexaconazol, Hymexazol,	
Imazalil, Imibenconazol, Iminoctadin, Iminoctadinealbesilat, Iminoctadinetriacetat, Iodocarb, Ipcnazol, Iprobenfos (TBP), Iprodione, Irumamycin, Isoprothiolan, Isovaledione, Iprovalicarb,	20
Kasugamycin, Kresoxim-methyl, Kupfer-Zubereitungen, wie: Kupferhydroxid, Kupfer-naphthenat, Kupferoxychlorid, Kupfersulfat, Kupferoxid, Oxin-Kupfer und Bordeaux-Mischung, Mancopper, Mancozeb, Maneb, Meferimzone, Mepanipyrim, Mepro-nil, Metalaxyl, Metconazol, Methasulfocarb, Metri-	
furoxam, Metiram, Metomeclam, Metsulfovax, Mildiomycin, Myclobutanil, Myclozolin, Nickel-dimethyldithiocarbamat, Nitrothal-isopropyl, Nuarimol,	25
Ofurace, Oxadixyl, Oxamocarb, Oxolinicacid, Oxycarboxim, Oxyfenthiin, Paclobutrazol, Pefurazoat, Penconazol, Pencycuron, Phosdiphen, Picoxystrobin, Pimaricin, Piperalin, Polyoxin, Polyoxorim, Probenazol, Prochloraz, Procymidon, Propamocarb, Propanosine-Natrium, Propiconazol, Propineb, Pyraclostro-	
bin, Pyrazophos, Pyrifenoxy, Pyrimethanil, Pyroquilon, Pyroxyfur, Quinconazol, Quintozen (PCNB), Quinoxifen,	30
Schwefel und Schwefel-Zubereitungen, Spiroxamine, Tebuconazol, Teclotalam, Tecnazen, Tetcyclacis, Tetraconazol, Thiabendazol, Thicyofen, Thifluzamide, Thiophanate-methyl, Thiram, Tioxymid, Tolclofos-methyl, Tolyfluanid, Triadimefon, Triadimenol, Triazbutyl, Triazoxid, Trichlamid, Tricyclazol, Tridemorph, Trifloxystrobin, Triflumizol, Triform, Triticonazol,	
Uniconazol,	35
Validamycin A, Vinclozolin, Viniconazol, Zarilamid, Zineb, Ziram sowie	
Dagger G, OK-8705, OK-8801,	40
$\alpha$ -(1,1-Dimethylethyl)- $\beta$ -(2-phenoxyethenoxyethyl)-1H-1,2,4-triazol-1-ethanol, $\alpha$ -(2,4-Dichlorphenyl)- $\beta$ -fluor-b-propyl-1H-1,2,4-triazol-1-ethanol, $\alpha$ -(2,4-Dichlorphenyl)- $\beta$ -methoxy-a-methyl-1H-1,2,4-triazol-1-ethanol, $\alpha$ -(5-Methyl-1,3-dioxan-5-yl)- $\beta$ -[[4-(trifluormethyl)-phenyl]-methylen]-1H-1,2,4-triazol-1-ethanol, (5RS,6RS)-6-Hydroxy-2,2,7,7-tetramethyl-5-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-3-octanon, (E)-a-(Methoxyimino)-N-methyl-2-phenoxy-phenylacetamid, 1-(2,4-Dichlorphenyl)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-ethanon-O-(phenylmethyl)-oxim, 1-(2-Methyl-1-naphthalenyl)-1H-pyrrol-2,5-dion, 1-(3,5-Dichlorphenyl)-3-(2-propenyl)-2,5-pyrrolidindion, 1-[(Diiodmethyl)-sulfonyl]-4-methyl-benzol, 1-[[2-(2,4-Dichlorphenyl)-1,3-dioxolan-2-yl]-methyl]-1H-imidazol, 1-[[2-(4-Chlorphenyl)-3-phenyloxiranyl]-methyl]-1H-1,2,4-triazol, 1-[1-[2-[(2,4-Dichlorphenyl)-methoxy]-phenyl]-ethenyl]-1H-imidazol, 1-Methyl-5-nonyl-2-(phenylmethyl)-3-pyrrolidinol, 2',6'-Dibrom-2-methyl-4'-trifluormethoxy-4'-trifluor-methyl-1,3-thiazol-5-carboxanilid, 2,6-Dichlor-5-(methylthio)-4-pyrimidinyl-thiocyanat, 2,6-Dichlor-N-(4-trifluormethylbenzyl)-benzamid, 2,6-Dichlor-N-[[4-(trifluormethyl)-phenyl]-methyl]-benzamid, 2-(2,3,3-Triiod-2-propenyl)-2H-tetrazol, 2-[(1-Methylethyl)-sulfonyl]-5-(trichlormethyl)-1,3,4-thiadiazol, 2-[[6-Deoxy-4-O-(4-O-methyl- $\beta$ -D-glycopyranosyl)-a-D-glucopyranosyl]-amino]-4-methoxy-1H-pyrrolo[2,3-d]pyri-	45
midin-5-carbonitril, 2-Aminobutan, 2-Brom-2-(brommethyl)-pentandinitril, 2-Chlor-N-(2,3-dihydro-1,1,3-trimethyl-1H-inden-4-yl)-3-ryridincarboxamid, 2-Chlor-N-(2,6-dimethylphenyl)-N-(isothiocyantatomethyl)-acetamid, 2-Phenylphenol(OPP), 3,4-Dichlor-1-[4-(difluormethoxy)-phenyl]-1H-pyrrol-2,5-dion,	50
	55
	60
	65

3,5-Dichlor-N-[cyan[(1-methyl-2-propynyl)-oxy]-methyl]-benzamid,  
 3-(1,1-Dimethylpropyl-1-oxo-1H-inden-2-carbonitril,  
 3-[2-(4-Chlorphenyl)-5-ethoxy-3-isoxazolidinyl]-pyridin,  
 4-Chlor-2-cyan-N,N-dimethyl-5-(4-methylphenyl)-1H-imidazol-1-sulfonamid,  
 5 4-Methyl-tetrazolo[1,5-a]quinazolin-5(4H)-on,  
 8-Hydroxychinolinsulfat,  
 9H-Xanthen-9-carbonsäure-2-[(phenylamino)-carbonyl]-hydrazid,  
 bis-(1-Methylethyl)-3-methyl-4-[(3-methylbenzoyl)-oxy]-2,5-thiophendicarboxylat,  
 cis-1-(4-Chlorphenyl)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-cycloheptanol,  
 10 cis-4-[3-[4-(1,1-Dimethylpropyl)-phenyl-2-methylpropyl]-2,6-dimethyl-morpholin-hydrochlorid,  
 Ethyl-[(4-chlorphenyl)-azo]-cyanoacetat,  
 Kaliumhydrogencarbonat,  
 Methantetrathiol-Natriumsalz,  
 Methyl-1-(2,3-dihydro-2,2-dimethyl-1H-inden-1-yl)-1H-imidazol-5-carboxylat,  
 15 Methyl-N-(2,6-dimethylphenyl)-N-(5-isoxazolylcarbonyl)-DL-alaninat,  
 Methyl-N-(chloracetyl)-N-(2,6-dimethylphenyl)-DL-alaninat,  
 N-(2,6-Dimethylphenyl)-2-methoxy-N-(tetrahydro-2-oxo-3-furanyl)-acetamid,  
 N-(2,6-Dimethylphenyl)-2-methoxy-N-(tetrahydro-2-oxo-3-thienyl)-acetamid,  
 N-(2-Chlor-4-nitrophenyl)-4-methyl-3-nitro-benzolsulfonamid,  
 20 N-(4-Cyclohexylphenyl)-1,4,5,6-tetrahydro-2-pyrimidinamin,  
 N-(4-Hexylphenyl)-1,4,5,6-tetrahydro-2-pyrimidinamin,  
 N-(5-Chlor-2-methylphenyl)-2-methoxy-N-(2-oxo-3-oxazolidinyl)-acetamid,  
 N-(6-Methoxy)-3-pyridinyl)-cyclopropanecarboxamid,  
 N-[2,2,2-Trichlor-1-[(chloracetyl)-amino]-ethyl]-benzamid,  
 25 N-[3-Chlor-4,5-bis-(2-propinyloxy)-phenyl]-N'-methoxy-methanimidamid,  
 N-Formyl-N-hydroxy-DL-alanin-Natriumsalz,  
 O,O-Diethyl-[2-(dipropylamino)-2-oxoethyl]-ethylphosphoramidothioat,  
 O-Methyl-S-phenyl-phenylpropylphosphoramidothioate,  
 S-Methyl-1,2,3-benzothiadiazol-7-carbothioat,  
 30 spiro[2H]-1-Benzopyran-2,1'(3'H)-isobenzofuran]-3'-on,  
 4-[3,4-Dimethoxyphenyl]-3-(4-fluorphenyl)-acryloyl]-morpholin

#### Bakterizide

35 Bronopol, Dichlorophen, Nitrapyrin, Nickel-dimethyldithiocarbamat, Kasugamycin, Octhilinon, Furancarbonsäure, Ox-  
 ytetraacyclin, Probenazol, Streptomycin, Tecloftalam, Kupfersulfat und andere Kupfer-Zubereitungen.

#### Insektizide/Akarizide/Nematizide

40 Abamectin, Acephate, Acetamiprid, Acrinathrin, Alanycarb, Aldicarb, Aldoxycarb, Alpha-cypermethrin, Alphamethrin,  
 Amitraz, Avermectin, AZ 60541, Azadirachtin, Azamethiphos, Azinphos A, Azinphos M, Azocyclotin,  
 Bacillus popilliae, Bacillus sphaericus, Bacillus subtilis, Bacillus thuringiensis, Baculoviren, Beauveria bassiana, Beau-  
 veria tenella, Bendiocarb, Benfuracarb, Bensultap, Benzoximate, Betacyfluthrin, Bifenazate, Bifenthrin, Bioethanome-  
 thrin, Biopermethrin, Bistrifluron, BPMC, Bromophos A, Bufencarb, Buprofezin, Butathiofos, Butocarboxim, Butylpy-  
 45 ridaben,  
 Cadusafos, Carbaryl, Carbofuran, Carbophenothion, Carbosulfan, Cartap, Chloethocarb, Chlorethoxyfos, Chlorfenapyr,  
 Chlorfenvinphos, Chlorfluazuron, Chlormephos, Chlorpyrifos, Chlorpyrifos M, Chlovaporthrin, Chromafenozide, Cis-  
 Resmethrin, Cispermethrin, Clocythrin, Cloethocarb, Clofentezine, Clothianidine, Cyanophos, Cycloprene, Cyclopro-  
 thrin, Cyfluthrin, Cyhalothrin, Cyhexatin, Cypermethrin, Cyromazine,  
 50 Deltamethrin, Demeton M, Demeton S, Demeton-S-methyl, Diafenthiuron, Diazinon, Dichlorvos, Dicofof, Diflubenz-  
 zuron, Dimethoat, Dimethylvinphos, Diofenolan, Disulfoton, Docusat-sodium, Dofenapyn,  
 Eflusilanate, Emamectin, Empenthrin, Endosulfan, Entomopffthora spp., Esfenvalerate, Ethiofencarb, Ethion, Ethopro-  
 phos, Etofenprox, Etoxazole, Etrimfos,  
 Fenamiphos, Fenazaquin, Fenbutatin oxide, Fenitrothion, Fenothiocarb, Fenoxacrim, Fenoxycarb, Fenpropathrin, Fen-  
 55 pyrad, Fenpyrithrin, Fenpyroximate, Fenvalerate, Fipronil, Fluazuron, Flubrocylthrin, Flucycloxuron, Flucythrinate,  
 Flufenoxuron, Flumethrin, Flutenzine, Fluvalinate, Fonophos, Fosmethilan, Fosthiazate, Fubfenprox, Furathiocarb,  
 Granuloseviren,  
 Halofenozide, HCH, Heptenophos, Hexaflumuron, Hexythiazox, Hydroprene,  
 Imidacloprid, Indoxacarb, Isazofos, Isafenphos, Isoxathion, Ivermectin,  
 60 Kernpolyederviren,  
 Lambda-cyhalothrin, Lufenuron,  
 Malathion, Mecarbam, Metaldehyd, Methamidophos, Metharhizium anisopliae, Metharhizium flavoviride, Methidat-  
 hion, Methiocarb, Methoprene, Methomyl, Methoxyfenozide, Metolcarb, Metoxadiazone, Mevinphos, Milbemectin,  
 Milbemycin, Monocrotophos,  
 65 Naled, Nitenpyram, Nithiazine, Novaluron,  
 Omethoat, Oxamyl, Oxydemeton M,  
 Paecilomyces fumosoroseus, Parathion A, Parathion M, Permethrin, Phenthoat, Phorat, Phosalone, Phosmet, Phospha-  
 midon, Phoxim, Pirimicarb, Pirimiphos A, Pirimiphos M, Profenofos, Promecarb, Propargite, Propoxur, Prothiofos, Pro-

thoat, Pymetrozine, Pyraclofos, Pyresmethrin, Pyrethrum, Pyridaben, Pyridathion, Pyrimidifen, Pyriproxyfen, Quinalphos, Ribavirin, Salithion, Sebufos, Silafluofen, Spinosad, Spirodiclofen, Sulfotep, Sulprofos, Tau-fluvalinate, Tebufenozide, Tebufenpyrad, Tebupirimiphos, Teflubenzuron, Tefluthrin, Temephos, Temvinphos, Terbufos, Tetrachlorvinphos, Tetradifon, Thetacypermethrin, Thiachlopid, Thiamethoxam, Thiapronil, Thiatriphos, Thiocyclam hydrogen oxalate, Thiodicarb, Thiofanox, Thuringiensin, Tralocyttrin, Tralomethrin, Triarathene, Triazamate, Triazophos, Triazuron, Trichlophenidine, Trichlorfon, Triflumuron, Trimethacarb, Vamidothion, Vaniliprole, Verticillium lecanii, YI 5302	5 10
Zeta-cypermethrin, Zolaprofos (1R-cis)-[5-(Phenylmethyl)-3-furanyl]-methyl-3-[(dihydro-2-oxo-3(2H)-furanylidene)-methyl]-2,2-dimethylcyclopropanecarboxylat (3-Phenoxyphenyl)-methyl-2,2,3,3-tetramethylcyclopropanecarboxylat 1-[(2-Chlor-5-thiazolyl)methyl]tetrahydro-3,5-dimethyl-N-nitro-1,3,5-triazin-2(1H)-imin 2-(2-Chlor-6-fluorphenyl)-4-[4-(1,1-dimethylethyl)phenyl]-4,5-dihydro-oxazol 2-(Acetyloxy)-3-dodecyl-1,4-naphthalindion 2-Chlor-N-[[[4-(1-phenylethoxy)-phenyl]-amino]-carbonyl]-benzamid 2-Chlor-N-[[[4-(2,2-dichlor-1,1-difluoroethoxy)-phenyl]-amino]-carbonyl]-benzamid 3-Methylphenyl-propylcarbammat 4-[4-(4-Ethoxyphenyl)-4-methylpentyl]-1-fluor-2-phenoxy-benzol 4-Chlor-2-(1,1-dimethylethyl)-5-[[2-(2,6-dimethyl-4-phenoxyphenoxy)ethyl]thio]-3(2H)-pyridazinon 4-Chlor-2-(2-chlor-2-methylpropyl)-5-[(6-iod-3-pyridinyl)methoxy]-3(2H)-pyridazinon 4-Chlor-5-[(6-chlor-3-pyridinyl)methoxy]-2-(3,4-dichlorphenyl)-3(2H)-pyridazinon Bacillus thuringiensis strain EG-2348 Benzoessäure [2-benzoyl-1-(1,1-dimethylethyl)-hydrazid Butansäure 2,2-dimethyl-3-(2,4-dichlorphenyl)-2-oxo-1-oxaspiro[4,5]dec-3-en-4-ylester [3-[(6-Chlor-3-pyridinyl)methyl]-2-thiazolidinyliden]-cyanamid Dihydro-2-(nitromethylen)-2H-1,3-thiazine-3(4H)-carbox aldehyd Ethyl-[2-[[1,6-dihydro-6-oxo-1-(phenylmethyl)-4-pyridazinyl]oxy]ethyl]-carbammat N-(3,4,4-Trifluor-1-oxo-3-butenyl)-glycin N-(4-Chlorphenyl)-3-[4-(difluormethoxy)phenyl]-4,5-dihydro-4-phenyl-1H-pyrazol-1-carboxamid N-[(2-Chlor-5-thiazolyl)methyl]-N'-methyl-N''-nitro-guanidin N-Methyl-N'-(1-methyl-2-propenyl)-1,2-hydrazindicarbothioamid N-Methyl-N'-2-propenyl-1,2-hydrazindicarbothioamid O,O-Diethyl-[2-(dipropylamino)-2-oxoethyl]-ethylphosphoramidothioat N-Cyanomethyl-4-trifluormethyl-nicotinamid 3,5-Dichlor-1-(3,3-dichlor-2-propenyloxy)-4-[3-(5-trifluormethylpyridin-2-yloxy)-propoxy]-benzol.	15 20 25 30 35 40
[0071] Auch eine Mischung mit anderen bekannten Wirkstoffen, wie Herbiziden oder mit Düngemitteln und Wachstumsregulatoren ist möglich.	40
[0072] Darüber hinaus weisen die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) auch sehr gute antimykotische Wirkungen auf. Sie besitzen ein sehr breites antimykotisches Wirkungsspektrum, insbesondere gegen Dermatophyten und Sprosspilze, Schimmel und diphasische Pilze (z. B. gegen Candida-Spezies wie Candida albicans, Candida glabrata) sowie Epidermophyton floccosum, Aspergillus-Spezies wie Aspergillus niger und Aspergillus fumigatus, Trichophyton-Spezies wie Trichophyton mentagrophytes, Microsporon-Spezies wie Microsporon canis und audouinii. Die Aufzählung dieser Pilze stellt keinesfalls eine Beschränkung des erfassbaren mykotischen Spektrums dar, sondern hat nur erläuternden Charakter.	45
[0073] Die Wirkstoffe können als solche, in Form ihrer Formulierungen oder den daraus bereiteten Anwendungsformen, wie gebrauchsfertige Lösungen, Suspensionen, Spritzpulver, Pasten, lösliche Pulver, Stäubemittel und Granulate angewendet werden. Die Anwendung geschieht in üblicher Weise, z. B. durch Gießen, Verspritzen, Versprühen, Verstreuen, Verstäuben, Verschäumen, Bestreichen usw.. Es ist ferner möglich, die Wirkstoffe nach dem Ultra-Low-Volume-Verfahren auszubringen oder die Wirkstoffzubereitung oder den Wirkstoff selbst in den Boden zu injizieren. Es kann auch das Saatgut der Pflanzen behandelt werden.	50
[0074] Beim Einsatz der erfindungsgemäßen Wirkstoffe als Fungizide können die Aufwandmengen je nach Applikationsart innerhalb eines größeren Bereiches variiert werden. Bei der Behandlung von Pflanzenteilen liegen die Aufwandmengen an Wirkstoff im allgemeinen zwischen 0,1 und 10.000 g/ha, vorzugsweise zwischen 10 und 1.000 g/ha. Bei der Saatgutbehandlung liegen die Aufwandmengen an Wirkstoff im allgemeinen zwischen 0,001 und 50 g pro Kilogramm Saatgut, vorzugsweise zwischen 0,01 und 10 g pro Kilogramm Saatgut. Bei der Behandlung des Bodens liegen die Aufwandmengen an Wirkstoff im allgemeinen zwischen 0,1 und 10.000 g/ha, vorzugsweise zwischen 1 und 5.000 g/ha.	55
[0075] Wie bereits oben erwähnt, können mit erfindungsgemäßen Wirkstoffen alle Pflanzen und deren Teile behandelt werden. In einer bevorzugten Ausführungsform werden wild vorkommende oder durch konventionelle biologische Zuchtmethoden, wie Kreuzung oder Protoplastenfusion erhaltenen Pflanzenarten und Pflanzensorten sowie deren Teile behandelt. In einer weiteren bevorzugten Ausführungsform werden transgene Pflanzen und Pflanzensorten, die durch gentechnologische Methoden gegebenenfalls in Kombination mit konventionellen Methoden erhalten wurden (Genetic Modified Organisms) und deren Teile behandelt. Der Begriff "Teile" bzw. "Teile von Pflanzen" oder "Pflanzenteile" wurde oben erläutert.	60 65
[0076] Besonders bevorzugt werden erfindungsgemäß Pflanzen der jeweils handelsüblichen oder in Gebrauch befindlichen Pflanzensorten behandelt. Unter Pflanzensorten versteht man Pflanzen mit neuen Eigenschaften ("Traits"), die so-	

wohl durch konventionelle Züchtung, durch Mutagenese oder durch rekombinante DNA-Techniken gezüchtet worden sind. Dies können Sorten, Rassen, Bio- und Genotypen sein.

[0077] Je nach Pflanzenarten bzw. Pflanzensorten, deren Standort und Wachstumsbedingungen (Böden, Klima, Vegetationsperiode, Ernährung) können durch die erfindungsgemäße Behandlung auch überadditive ("synergistische") Effekte auftreten. So sind beispielsweise erniedrigte Aufwandmengen und/oder Erweiterungen des Wirkungsspektrums und/oder eine Verstärkung der Wirkung der erfindungsgemäß verwendbaren Stoffe und Mittel, besseres Pflanzenwachstum, erhöhte Toleranz gegenüber hohen oder niedrigen Temperaturen, erhöhte Toleranz gegen Trockenheit oder gegen Wasser- bzw. Bodensalzgehalt, erhöhte Blühleistung, erleichterte Ernte, Beschleunigung der Reife, höhere Ernteerträge, höhere Qualität und/oder höherer Ernährungswert der Ernteprodukte, höhere Lagerfähigkeit und/oder Bearbeitbarkeit der Ernteprodukte möglich, die über die eigentlich zu erwartenden Effekte hinausgehen.

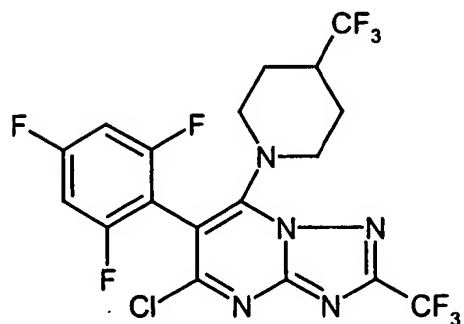
[0078] Zu den bevorzugten erfindungsgemäß zu behandelnden transgenen (gentechnologisch erhaltenen) Pflanzen bzw. Pflanzensorten gehören alle Pflanzen, die durch die gentechnologische Modifikation genetisches Material erhielten, welches diesen Pflanzen besondere vorteilhafte wertvolle Eigenschaften ("Traits") verleiht. Beispiele für solche Eigenschaften sind besseres Pflanzenwachstum, erhöhte Toleranz gegenüber hohen oder niedrigen Temperaturen, erhöhte Toleranz gegen Trockenheit oder gegen Wasser- bzw. Bodensalzgehalt, erhöhte Blühleistung, erleichterte Ernte, Beschleunigung der Reife, höhere Ernteerträge, höhere Qualität und/oder höherer Ernährungswert der Ernteprodukte, höhere Lagerfähigkeit und/oder Bearbeitbarkeit der Ernteprodukte. Weitere und besonders hervorgehobene Beispiele für solche Eigenschaften sind eine erhöhte Abwehr der Pflanzen gegen tierische und mikrobielle Schädlinge, wie gegenüber Insekten, Milben, pflanzenpathogenen Pilzen, Bakterien und/oder Viren sowie eine erhöhte Toleranz der Pflanzen gegen bestimmte herbizide Wirkstoffe. Als Beispiele transgener Pflanzen werden die wichtigen Kulturpflanzen, wie Getreide (Weizen, Reis), Mais, Soja, Kartoffel, Baumwolle, Raps sowie Obstpflanzen (mit den Früchten Äpfel, Birnen, Zitrusfrüchten und Weintrauben) erwähnt, wobei Mais, Soja, Kartoffel, Baumwolle und Raps besonders hervorgehoben werden. Als Eigenschaften ("Traits") werden besonders hervorgehoben die erhöhte Abwehr der Pflanzen gegen Insekten durch in den Pflanzen entstehende Toxine, insbesondere solche, die durch das genetische Material aus *Bacillus thuringiensis* (z. B. durch die Gene CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c, Cry2Ab, Cry3Bb und CryIF sowie deren Kombinationen) in den Pflanzen erzeugt werden (im folgenden "Bt Pflanzen"). Als Eigenschaften ("Traits") werden auch besonders hervorgehoben die erhöhte Abwehr von Pflanzen gegen Pilze, Bakterien und Viren durch Systemische Akquirierte Resistenz (SAR), Systemin, Phytoalexine, Elicitoren sowie Resistenzgene und entsprechend exprimierte Proteine und Toxine. Als Eigenschaften ("Traits") werden weiterhin besonders hervorgehoben die erhöhte Toleranz der Pflanzen gegenüber bestimmten herbiziden Wirkstoffen, beispielsweise Imidazolinonen, Sulfonylharnstoffen, Glyphosate oder Phosphinotricin (z. B. "PAT"-Gen). Die jeweils die gewünschten Eigenschaften ("Traits") verleihenden Gene können auch in Kombinationen miteinander in den transgenen Pflanzen vorkommen. Als Beispiele für "Bt Pflanzen" seien Maissorten, Baumwollsorten, Sojasorten und Kartoffelsorten genannt, die unter den Handelsbezeichnungen YIELD GARD® (z. B. Mais, Baumwolle, Soja), KnockOut® (z. B. Mais), StarLink® (z. B. Mais), Bollgard® (Baumwolle), Nucoton® (Baumwolle) und NewLeaf® (Kartoffel) vertrieben werden. Als Beispiele für Herbizidtolerante Pflanzen seien Maissorten, Baumwollsorten und Sojasorten genannt, die unter den Handelsbezeichnungen Roundup Ready® (Toleranz gegen Glyphosate z. B. Mais, Baumwolle, Soja), Liberty Link® (Toleranz gegen Phosphinotricin, z. B. Raps), IMI® (Toleranz gegen Imidazolinone) und STS® (Toleranz gegen Sulfonylharnstoffe z. B. Mais) vertrieben werden. Als Herbizid resistente (konventionell auf Herbizid-Toleranz gezüchtete) Pflanzen seien auch die unter der Bezeichnung Clearfield® vertriebenen Sorten (z. B. Mais) erwähnt. Selbstverständlich gelten diese Aussagen auch für in der Zukunft entwickelte bzw. zukünftig auf den Markt kommende Pflanzensorten mit diesen oder zukünftig entwickelten genetischen Eigenschaften ("Traits").

[0079] Die aufgeführten Pflanzen können besonders vorteilhaft mit den erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) behandelt werden. Die bei den Wirkstoffen oben angegebenen Vorzugsbereiche gelten auch für die Behandlung dieser Pflanzen. Besonders hervorgehoben sei die Pflanzenbehandlung mit den im vorliegenden Text speziell aufgeführten Verbindungen.

[0080] Die Erfindung wird durch die folgenden Beispiele veranschaulicht.

#### Herstellungsbeispiele

##### Beispiel 1



##### Verfahren (a)

[0081] In eine Lösung von 0,7 g (181 mMol) 5,7-Dichlor-2-(trifluormethyl)-6-(2,4,6-trifluorphenyl)[1,2,4]tria-

zolo[1,5-a]pyrimidin und 0,28 g (1,81 mMol) 4-Trifluormethylpiperidin in 20 ml Dichlormethan werden 0,18 g Triethylamin gegeben. Das Gemisch wird 18 Stunden bei Raumtemperatur gerührt. Danach wird das Reaktionsgemisch mit soviel 1 N Salzsäure versetzt und gerührt, dass der pH-Wert der Mischung bei 1–2 liegt (ca. 50 ml). Die organische Phase wird abgetrennt, über Natriumsulfat getrocknet und unter vermindertem Druck eingeeengt. Der Rückstand wird mit Petrolether verrührt und abgesaugt. Man erhält 0,3 g (30,3% der Theorie) 5-Chlor-2-(trifluormethyl)-7-[4-trifluormethyl]-1-piperidiny]-6-(2,4,6-trifluorphenyl)[1,2,4]-triazolo[1,5-a]pyrimidin.

HPLC: logP = 4,43

**[0082]** Nach den zuvor angegebenen Methoden werden auch die in der nachstehenden Tabelle 1 aufgeführten Verbindungen der Formel (I) erhalten.

10

15

20

25

30

35

40

45

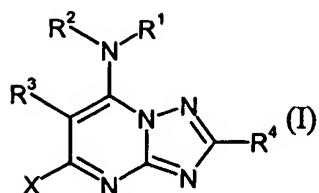
50

55

60

65

Tabelle 1



Bsp.Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	X	logP*
2	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH(CF <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -		2,4,6-Trifluorophenyl	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-Cl	3,99
3		-H	2,4,6-Trifluorophenyl	-CF <sub>3</sub>	-Cl	3,94
4		-H	2,4,6-Trifluorophenyl	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-Cl	3,39
5	-CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub>	-H	2,4,6-Trifluorophenyl	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-Cl	3,06
6	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub>	-H	2,4,6-Trifluorophenyl	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-Cl	3,18
7	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub>	-H	2,4,6-Trifluorophenyl	-CF <sub>3</sub>	-Cl	3,76
8	-CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub>	-H	2,4,6-Trifluorophenyl	-CF <sub>3</sub>	-Cl	3,64
9		-H	2,4,6-Trifluorophenyl	t-Butyl	-Cl	4,24
10	-CH <sub>2</sub> -C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2,4,6-Trifluorophenyl	-CF <sub>3</sub>	-Cl	4,73
11	-i-Propyl	-H	2,4,6-Trifluorophenyl	-CF <sub>3</sub>	-Cl	3,8

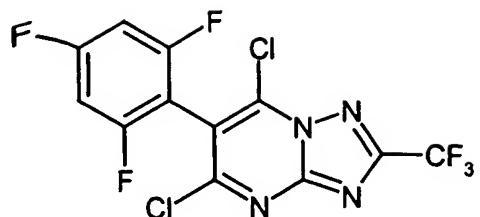
# steht für die Anknüpfungsstelle

\*) Die Bestimmung der logP-Werte erfolgte gemäß EEC-Directive 79/831 Annex V. A8 durch HPLC (Gradientenmethode, Acetonitril/0,1 % wässrige Phosphorsäure)



## Herstellung von Ausgangsstoffen

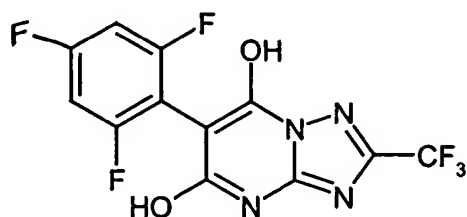
## Beispiel 12



(II-1)

[0083] 2,6 g (7,43 mMol) 2-Trifluormethyl-6-(2,4,6-trifluorphenyl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]-pyrimidin-5,7-diol werden bei Raumtemperatur in 20 ml Phosphoroxychlorid gelöst, portionsweise mit 1,2 g Phosphorpentachlorid versetzt und anschließend 6 Stunden unter Rückfluss erhitzt. Flüchtige Bestandteile der Reaktionsmischung werden unter vermindertem Druck abdestilliert. Der Rückstand wird mit 20 ml Wasser versetzt und mit 20 ml Dichlormethan extrahiert. Die organische Phase wird über Natriumsulfat getrocknet und an Kieselgel mit Dichlormethan chromatografiert. Man erhält 1,2 g (37,6% der Theorie) 5,7-Dichlor-2-(trifluormethyl)-6-(2,4,6-trifluorphenyl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin. HPLC: logP = 3,71

## Beispiel 13

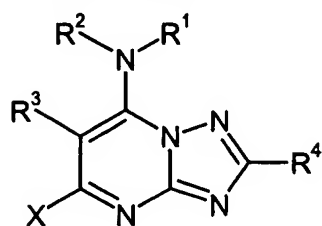


(V-1)

[0084] 10,1 g (38,5 mMol) 2-(2,4,6-trifluor-phenyl)malonsäuredimethylester und 5,85 g (38,5 mMol) 5-Trifluormethyl-1H-[1,2,4]triazol-3-ylamin werden in 10,1 ml Tri-n-Butylamin 6 Stunden auf 180°C erhitzt, wobei entstehendes Methanol abdestilliert wird. Das Tri-n-Butylamin wird unter stark vermindertem Druck abdestilliert. Man erhält 17,8 g rohes 2-Trifluormethyl-6-(2,4,6-trifluor-phenyl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]-pyrimidin-5,7-diol, das ohne Reinigung weiter umgesetzt wird. HPLC: logP = 0,81

## Patentansprüche

## 1. Triazolopyrimidine der Formel



(I),

in welcher

R<sup>1</sup> für gegebenenfalls substituiertes Alkyl, gegebenenfalls substituiertes Alkenyl, gegebenenfalls substituiertes Alkyl, gegebenenfalls substituiertes Cycloalkyl, gegebenenfalls substituiertes Alkoxy, gegebenenfalls substituiertes Alkenyloxy, gegebenenfalls substituiertes Alkinyloxy, gegebenenfalls substituiertes Cycloalkyloxy, gegebenenfalls substituiertes Alkylamino, gegebenenfalls substituiertes Dialkylamino, gegebenenfalls substituiertes Alkenylamino, gegebenenfalls substituiertes Alkylamino, gegebenenfalls substituiertes Cycloalkylamino, gegebenenfalls substituiertes N-Cycloalkyl-N-alkylamino, gegebenenfalls substituiertes Alkylidenamino, gegebenenfalls substituiertes Heterocyclyl oder für einen Rest der Formel -S-R<sup>5</sup> steht, worin

R<sup>5</sup> für gegebenenfalls substituiertes Alkyl, gegebenenfalls substituiertes Alkenyl, gegebenenfalls substituiertes Alkyl, gegebenenfalls substituiertes Cycloalkyl steht,

R<sup>2</sup> für Wasserstoff, gegebenenfalls substituiertes Alkyl, gegebenenfalls substituiertes Alkenyl, gegebenenfalls substituiertes Alkyl oder gegebenenfalls substituiertes Cycloalkyl steht, oder

R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für einen gegebenenfalls substituierten heterocyclischen Ring stehen,

R<sup>3</sup> für gegebenenfalls einfach bis vierfach substituiertes Alkyl steht,

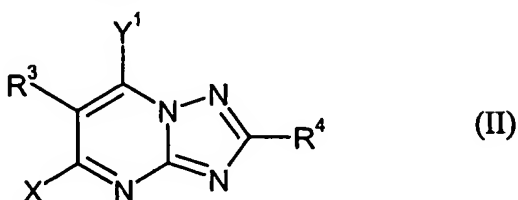
R<sup>4</sup> für gegebenenfalls substituiertes Alkyl steht und

X für Halogen steht.

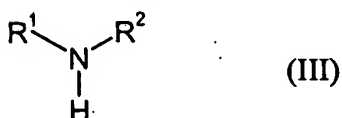
2. Verfahren zur Herstellung von Triazolopyrimidinen der Formel (I) gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet,

dass man

a) Dihalogen-triazolopyrimidine der Formel



in welcher  
R³, R⁴ und X die oben angegebenen Bedeutungen haben und  
Y¹ für Halogen steht,  
mit Aminen der Formel

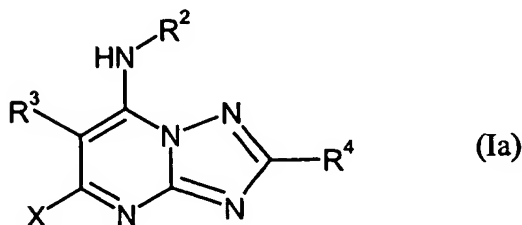


20

in welcher  
R¹ und R² die oben angegebenen Bedeutungen haben,  
gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säureakzeptors umgesetzt,  
oder

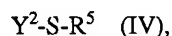
25

b) Triazolopyrimidine der Formel



35

in welcher  
R², R³, R⁴ und X die oben angegebenen Bedeutungen haben,  
mit Sulfensäurehalogeniden der Formel



in welcher  
R⁵ die oben angegebenen Bedeutungen hat und  
Y² für Halogen steht,  
gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säureakzeptors umgesetzt.

45

3. Mittel zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen, gekennzeichnet durch einen Gehalt an mindestens einem Triazolopyrimidin der Formel (I) gemäß Anspruch 1 neben Streckmitteln und/oder oberflächenaktiven Stoffen.

50

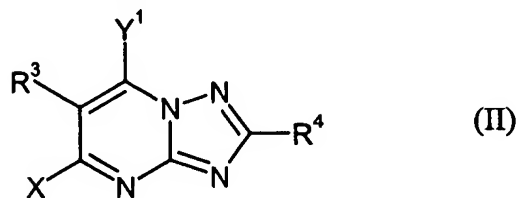
4. Verwendung von Triazolopyrimidinen der Formel (I) gemäß Anspruch 1 zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen.

5. Verfahren zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen, dadurch gekennzeichnet, dass man Triazolopyrimidine der Formel (I) gemäß Anspruch 1 auf die unerwünschten Mikroorganismen und/oder deren Lebensraum ausbringt.

55

6. Verfahren zur Herstellung von Mitteln zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen, dadurch gekennzeichnet, dass man Triazolopyrimidine der Formel (I) gemäß Anspruch 1 mit Streckmitteln und/oder oberflächenaktiven Stoffen vermischt.

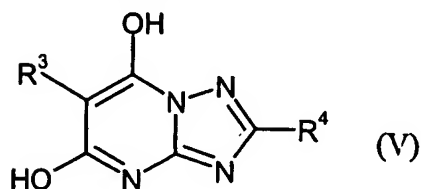
7. Dihalogen-triazolopyrimidine der Formel



65

in welcher  
R³, R⁴ und X die oben angegebenen Bedeutungen haben und  
Y¹ für Halogen steht.

8. Verfahren zur Herstellung von Dihalogen-triazolopyrimidinen der Formel (II) gemäß Anspruch 7, dadurch gekennzeichnet, dass man (c) Dihydroxytriazolopyrimidine der Formel



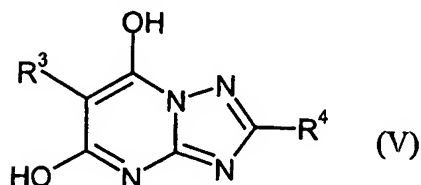
5

in welcher

10

$R^3$  und  $R^4$  die oben angegebenen Bedeutungen haben, mit Halogenierungsmitteln, gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt.

9. Dihydroxy-triazolopyrimidine der Formel



15

20

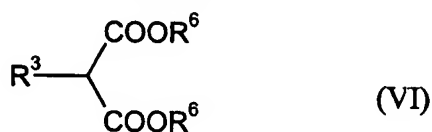
in welcher

$R^3$  und  $R^4$  die oben angegebenen Bedeutungen haben.

10. Verfahren zur Herstellung von Dihydroxy-triazolopyrimidinen der Formel (V) gemäß Anspruch 9, dadurch gekennzeichnet, dass man

25

d) Arylmalonester der Formel

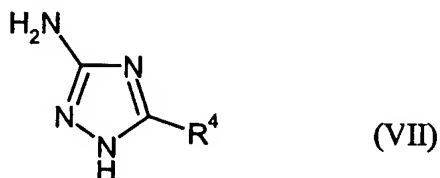


30

in welcher

$R^3$  die oben angegebenen Bedeutungen hat und  $R^6$  für Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen steht, mit Aminotriazolen der Formel

35



40

in welcher

45

$R^4$  die oben angegebenen Bedeutungen hat, gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels umgesetzt.

50

55

60

65

- Leerseite -

**This Page is Inserted by IFW Indexing and Scanning  
Operations and is not part of the Official Record**

**BEST AVAILABLE IMAGES**

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images include but are not limited to the items checked:

- ☐ **BLACK BORDERS**
- ☒ **IMAGE CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES**
- ☐ **FADED TEXT OR DRAWING**
- ☐ **BLURRED OR ILLEGIBLE TEXT OR DRAWING**
- ☐ **SKEWED/SLANTED IMAGES**
- ☐ **COLOR OR BLACK AND WHITE PHOTOGRAPHS**
- ☐ **GRAY SCALE DOCUMENTS**
- ☐ **LINE(S) OR MARK(S) ON ORIGINAL DOCUMENT**
- ☐ **REFERENCE(S) OR EXHIBIT(S) SUBMITTED ARE POOR QUALITY**
- ☐ **OTHER:** \_\_\_\_\_

**IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.**

**As rescanning these documents will not correct the image problems checked, please do not report these problems to the IFW Image Problem Mailbox.**